

⑬ 日本国特許庁 (JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55—124763

⑪ Int. Cl.⁹
C 07 D 213/64
213/70

識別記号 庁内整理番号
7138—4C
7138—4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 3 頁)

④ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

⑪ 特 願 昭54—32068

⑫ 出 願 昭54(1979)3月19日

⑫ 発 明 者 西山隆三
高槻市真上町5丁目41番22号

⑫ 発 明 者 藤川政一
守山市浮気町321番地の31

⑫ 発 明 者 横道勲
草津市野村町221番地

⑫ 発 明 者 芳賀隆弘

草津市野村町221番地

⑫ 発 明 者 長谷邦昭

守山市浮気町321番地の31

⑫ 発 明 者 林弘仁

守山市浮気町321番地の31

⑫ 出 願 人 石原産業株式会社

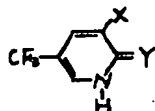
大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

明 細 書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-
ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

1. 一般式

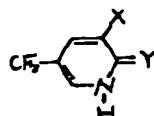


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中間原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

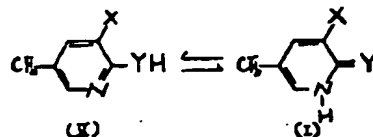
詳しくは本発明は一般式



(I)

(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

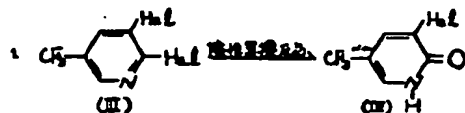
前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。



(式中X及びYは前述の通りである)

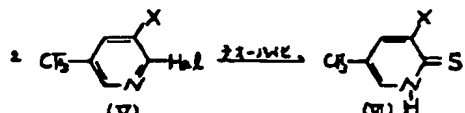
前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、塩素、臭素、碘素が挙げられる。

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ビリ
ドン誘導体は通常、例えば下記方法によって製
造される。



(上記反応式中 Hald はハロゲン原子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジ
メチルホルムアミドなどの非プロトン性無性溶
媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど
のアルカリ水溶液を用いて50〜150℃、0.1
〜10時間で行なわれる。



(上記反応式中 X 及び Hald は前述の通りで
ある)

一般に上記反応はメタノール、エタノールな
どのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジ
メチルホルムアミドなどの非プロトン性無性溶

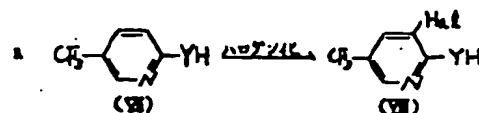
- 3 -

媒とを反応させることによりN-ベンゾ
イル-N'-[4-(5-トリフルオロメチルビリ
ジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレア系化
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリ
ドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを
縮合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2
,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを
反応させると、N-(2,6-ジフルオロベン
ゾイル)-N'-[3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-
イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることがで
きる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた
活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆虫の
防除に有効であって、例えばこの化合物100
ppm 濃度溶液にキャベツの葉片を浸漬し、それ
を風乾してそこに2〜3頭のコナガの幼虫を放
ち、8日に生死を判定した結果、100%の

- 5 -

H隆昭55-124763(2)

死などの誘導中、チオ尿素、酸化ソーダ、チオ
硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミ
ン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50〜
室温温度0.5〜10時間で行なわれる。



(上記反応式中 Y 及び Hald は前述の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、
酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性無性溶媒
などの溶媒中、塩素ガス、臭素、チオニクロ
ライド、スルフリルクロライドなどのハロゲン
化剤を用いて0〜100℃、0.5〜10時間で行
なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベ
ンゼン類と縮合させて4-(5-トリフルオロ
メチルビリジン-2-イルオキシ)ニトロベ
ンゼン類を生成させ、これを還元して得られる4
-(5-トリフルオロメチルビリジン-2-イ
ルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシアキ

- 4 -

死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的な合成例を記載する。

合成例 1 3-クロロ-5-トリフルオロメチ
ル-2-ビリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ビリドン0
2gをクロロホルム20mlに溶解させ、50
℃に加熱して塩素ガスを1時間攪拌下に通じ
た。反応終了後、クロロホルムを蒸発し、ト
ルエン-n-ヘキサンとの混合溶媒で再結晶し
て融点144〜147℃の目的物0.15gを
得た。

(B)

水酸化ナトリウム2.4gを水125mlに溶
解させた水溶液に2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロメチルビリジン4gを加え、更にジ
メチルスルホキシド25mlを加えて加熱し、
110℃で1時間攪拌下に反応させた。反応
終了後生成物を蒸発し、最少量で酸性にして
沈殿物を得、このものを過濾して目的物25

- 6 -

ヲを得た。

合成例 2 5-トリフルオロノテル-2-チオ
ビリドン

2-クロロ-5-トリフルオロノテルヒリ
ジン4ヲとチオ尿素167ヲとをエタノール
30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ
ウム水溶液123ヲを徐々に加えて還流状態
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ
ンを留去して融点147~150℃の目的物
2.1ヲを得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロノテ
ル-2-ビリドン

5-トリフルオロノテル-2-ビリドン0.
4ヲを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0.
4ヲを加えて攪拌下で4時間反応させた。反

- 7 -

特願55-124763(3)

応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-ロ
-ヘキサンの混合溶液で再結晶して融点162
~165℃の目的物0.45ヲを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロノテ
ル-2-チオビリドン

2-クロロ-5-トリフルオロノテルヒリ
ジン4ヲに代えて2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロノテルヒリジン4.75ヲを用いる以
外は前記合成例2と同様にして反応を行ない、
後処理を行なって融点125~128℃の目
的物1.9ヲを得た。

特許出願人 石原産業株式会社

- 8 完 -